This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problem Mailbox.

RÉPUBLIQUE FRANÇAISE

INSTITUT MATIONAL DE LA PROPRIÉTÉ INDUSTRIELLE

PARIS-

commandes de reproduction)

2.133.024

No d'enregistrement national :

lA unliser pour les paiements d'annuités les demandes de copies officielles et toutes autres correspondances avec [1.N.P.1.)

® BREVET D'INVENTION

PREMIÈRE ET UNIQUE **PUBLICATION**

(22) Date de dépôt Date de la décision de délivrance.....

Publication de la délivrance.....

6 avril 1971, à 15 h 47 mn.

30 octobre 1972.

B.O.P.I. - (Lister) n. 47 du 24-11-1972.

(5) Classification internationale (Int. Cl.) C 07 d 31/00.

(71) Déposant : ARIES Robert, 69, rue de la Faisanderie, Paris (16).

(73) Titulaire: Idem (71)

(74) Mandataire:

(54) Dérivés nicotiniques du mobucoi.

(72)Invention de : Robert Aries.

Priorité conventionnelle :

4 1

71 12107

2133024

la présente invention se rapporte à des problits industriels nouveau constitués par des cetere d'elvis des acides nicotiniques et des bis (hydron- pherylthia) - heares.

les amposés visis per Plinyontion sout Shiffale ger in for ale y minimale i di-arris :

Dans cette formule, la fonction I-oxyde est facultative: R' représente un reste alcoyle léger ou un atome d'hydrogène; an représente un reste méthyle on éthyle;

and représente un reste tertionnele ou tertiobatique; 15 With providing the control of the England of the

acs causas and invention possèdent des propriétés pharmacodynamiques hypotheless by the dantes of hypotheless.

L'invention viville i procédés de fabrication des composés Minis par la formule defeale ci-deseus. 20

Con mochais consistent dans liaction do libologérare on de lighradride de l'acide risotinique ou de son Le : le sur un his(hu irony-4 miénulthio) alcane de formule générale al suivante :

38 Hors leavolle 21, 24, 241, 244 sept tels withs out 500 wolf-fives upon-2 demograph:

we réaction est ellectuée, de la férence, dans un liquide inerté מפריים ביות ממלייים למינים ביות מוני סבל, מה כר המש פצמשקונה, את השישה מתפודה את ໍ່ຊິນຄະພາການໃດ. ກາງ ທີ່ກໍ່ສາດດາດໃສ່ ການການເລັດ. ການ 22. ພາຍໃຊ້ນີ້ຂອກກິດຕານໃດ ຄານ ໂດຍນາຍ ຫນໍ້ວິນກ is in a commo. To profiber not, i was for porature subdefigure a colle de יש שונים ומות של שונים של האינון שני היא לואם ביו ליו ואיני שנים ביו של מות ביו אל יותר אל יותר ביותר 0453356

-corer, am origer de diame base destinée à fixer Chan' does la minabiga la diffe berr constant 8tha

.: }

とエフフリンは・

par exemple, un hydronyde ou un carbonate alcalin, une arine tertialre où un hétéroryele ament "estapime, est dernierm consette en en rartie eu ou totalifé de solvant des mérenisse en un un corte. Com ent ausai effica-නහතු වැට සිට්වේ වර මිසි තිබීම්මින්න දෙක්වේ සිට් කුතුකර් වනවට වැනිවේ. මුල වර්ගේ පවතු දෙවාසුව artitle alarre.

Everple 1

Misinicotine or -4 difertion y -2,5 (Elmithio)-2,2 protone

200 arms res (0,5 male) de bis(fithertiobutyl-), o hy croxy-h yhénylthio) -2,2 propane et 101 grannes (1 mole) de tranthy a line cont introducts 10 dons + litres de beraème sec; an ajoute peu ' veu 142 grappe s (1 mole) de chlorure de nisotinoyle; on agite jendant 30 minutés juis gerate rogressivement ou reflux quion maintient pendant 30 minutes; on filtre, cers refroidir, your éliminer le chlorhydrate de triéthylamine puis évarore le benzène sous pression réduite; on lave evec un peu de pentane 15 et sêche sous wide.

Exer. le 2

En remplaçant le bis(ditertiobuty1-5,5 hydroxy-4 phénylthio)-2,2 propare par une quantité équinoléculaire d'un autre bis (hydroxy-4 phinylthio) aloure, conforme à la formule II, dans la réaction de 20 l'exemple I, on pout, notamment, obtenir les composés suivants : Tis(nicotinoyloxy-4 ditertiobutyl-3.5 phénylthio)-1,7 promine Pis(nicotinoyloxy)-4 ditertiobuty1-3,5 phénylthio)-1,1 éthane Bis(nicotinoyloxy)-4 ditertiobuty1-3,5 phonylthio)-2,2 butane Bis(nicotinoyloxy)-4 ditertiobuty1-3,5 phénylthio)-2,2 hexone 25 Bis(nicotinoyloxy)-4 ditertionmy1-5,5 phénylthio)-2,2 progand Bis(nicotinoyloxy)-4 réthyl-3 tertiobutyl-5 phénylthio)-2,2 propane Bis(nicotinoyloxy)-4 isopropyl-3 tertiobutyl-5 phonylthio)-2,2 propane Bis(nicotinoyloxy)-4 iso re-y1-5 tertiobuty1-5 phénylthio)-1,1 éthane Bis(nicotinoyloxy)-4 isopropyl-3 tertiobutyl-5 ph@tylthio)-2,2 rentane ٥ر

Exercise >

En remplaçant le chlorure de risotimente en une quantité équimoléculaire de chlorure de N-oxyde de nicotinoyle dans les exemples 1 et 2, en peut, netamment, obterir les composés srivants : Ris(N-crynicotinoploxy-4 difertiobuty)-5.5 phonylthio)-2.2 propare Dis(nicotizogloxy-4 difertiobutyl-9,5 mishylthin)-1,1 mmomane Pis(K-oxymicotinoplowy)-4 ditertiobutyl-p.5 phonylthio)-1,1 Othane Bis(H-omymicotingplony)-4 fitor fobrtyl-3,5 phOnylthio)-2,2 butane Pis(Hepayericatinoploxy)-4 ditertiobaty) 3,5 Thenylthic)-2,2 heranc ... Bis(H-oxyminotinogloxy)-4 mothyd-5 tertiobutyl-5 phonolthio,-1,2 progane 71 12107

3

2133024

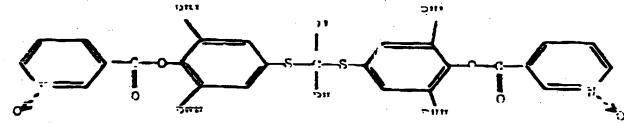
Bis(N-oxymicotinoyloxy)-4 isopropyl-3 tertiobutyl-5 phénylthio)-2,2 propens

Bis(N-oxymicotinoyloxy)-4 isopropyl-3 tertiobutyl-5 phémylthio)-1,1 éthane

5 Bis(N-oxymicotinoyloxy)-4 isopropyl-3 tertiobutyl-5 phénylthio)-2,2 pentane

Revision Italian

1°. Produits industriels constituis per les composée ééfénis par la formule gérérale I suivante :



10 dens laquelle la fonction L-oxyde est facultative;

Ri représente un reste alcoyle léter ou un atone d'hydrogène;

2" représente un reste réthyle ou ét ple;

Rut représente un reste tertionnyle on tertiobatyle;

Run représents un reste alcoyle liver;

15 2°. Froduit industriel conforme has president revendication constitué par le Bis(nicotilo 1-4 liter soluter...) Médiglithe 2,2 propose 5°. Produits industriels conformes à la première revendication constitués

par les composés suivents :

Fis(micotinoyloxy-4 ditertiobuty1-3,5 phénylthio)-1,1 propane

20 Bis(micotinoyloxy)-4 ditertiobutyl+3,5 phémylthio)-1,1 éthane

his(nicotinorloxy)-4 ditertiobuty1-3.5 phinylthio)-2,2 butane

Bis(nicotinoyloxy)-4 ditortiobuty1-5,5 phény1thio)-2,2 hexane

Bis(nicotingyloxy)-4 diterticary1-3,5 phénylthio)-2,2 propane

Bis(vicetinoyloxy)-4 m thyl-3 tertiobuty1-5 phénylthio)-2,2 propane

- 25 Bis(nicotinoploxy'-4 disorrogel-3 'enticoutyl-5 phénylthio)-2,2 propare
 - Bis(nicotinoyloxy)-4 isagrogy1-3 *ertiobuty1-5 phénylthio)-1,1 éthanc
 - Bis(nisotinoyloxy)-4 isogropyl-3 tertiabutyl-5 phénylthio)-2,2 pentane

 - 4°. Produits industriels conformes ? la première revendication constitués

perles composis suivants:

30 Bis(N-oxymicotinoyloxy-4 ditertiobutyl-3,5 phing)thio)-2,2 propane
Bis(nicotinoyloxy-4 ditertiobutyl-3,5 phing)thio)-1,1 propane
Bis(N-oxymicotinoyloxy)-4 ditertiobutyl-3,5 phinglthio)-1,1 dthame

Bis(H-exprisetinoyleng)-4 ditortiobutyl-3,5 phénylthic)-2.2 butone

Pis(N-exymicotinovloxy)-4 ditertiobuty1-3,5 phénylthio)-2,2 hexane

)5 Bis(H-saymisotinoyloxy)-4 ditertioanyl-5,5 ;henyIthio)-2,2 propans

Fig(K-oxymicoticoyloxy)-4 méthyl-3 tertichutyl-5 phénylthio)-2,2 propens

Sis(S-expulsetineyloxy)-4 isopropyl-5 tertiabutyl-5 phonylthie)-2.2

tropare

Fis(N-exymicatineylery)-4 isopropul-5 terminbutyl-5 phinylthie)-1,1

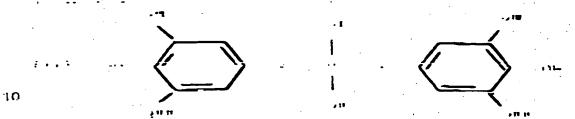
TEL:703-415-1557

71 12107

2133024

- Fir(N-anymicoff.or), vp -0 for the TL-3 fortiobutyl-5 phonylthio)-2,2 montage.

if a area tie de finanta it an emminiant dans l'inntion d'un halomeure on Cooks for our to man Heattein and up Traffic and the control and the above of a second of the control o · ----.



office largelle Rt. Rt. Rt. Rt. Rt. Sont comie il cit dit dans la prordère reverdication.

6° Procédé conforme à la reviscion las Soume l'étice per la présence where letifies what impositione base windries or dime swine terminine The true better constitute the testing

ve. Impocédé conforme à la messadiantion à comaciómini con literal de disc Siety: Oppgegilinge du bis (hidroxy-4 shinglinin) alence de formule II.